

RESUMO

Aos núcleos imidazolidínico e tiazolidínico, devido à sua reatividade química e conseqüente afinidade por biomacromoléculas, são atribuídos diversas atividades biológicas, fato que direcionou nossas pesquisas na busca de novos agentes biologicamente ativos das séries 5-arilideno-3-(4-metil-benzil)-tiazolidina-2,4-diona e 5-benzilideno-3-(4-flúor-benzil)-4-tioxo-imidazolidin-2-ona. A substituição em posição 3 do anel heterocíclico, em meio alcalino, foi realizada pela utilização do cloreto de 4-metil-benzil para o núcleo tiazolidínico e do brometo de 4-flúor-benzil para o núcleo imidazolidínico. A 3-(4-flúor-benzil)-imidazolidina-2,4-diona sofreu uma tionação na carbonila da posição 4. Em seguida, a substituição em posição 5 dos derivados tiazolidínicos e imidazolidínicos foi realizada por uma adição do tipo Michael da 3-(4-metil-benzil)-tiazolidina-2,4-diona e da 3-(4-flúor-benzil)-4-tioxo-imidazolidin-2-ona com derivados 3-aryl-2-ciano-acrilatos de etila substituídos. As estruturas químicas dos compostos sintetizados foram devidamente comprovadas por espectroscopia de infravermelho e de ressonância magnética nuclear de hidrogênio. Os ensaios antiinflamatórios foram realizados através do método de indução do edema de pata com a carragenina em ratos Wistar, para os derivados 5-arilideno-3-(4-metil-benzil)-tiazolidina-2,4-diona, utilizando a indometacina como padrão.

ABSTRACT

Several biological activities are assigned to the imidazolidinic and thiazolidinic rings due to the chemical reactivity and consequently affinity for biomacromolecules. This fact led our researches though they seek biologically active agents of the series of 5-arylidene-3-(4-methyl-benzyl)-thiazolidin-2,4-dione and 5-benzylidene-3-(4-fluor-benzyl)-thioxo-imidazolidin-2-one. The substitution in position 3 of the heterocyclic ring, in alkaline medium, was carried out by the use of 4-methyl-benzyl chloride, to the thiazolidinic ring, and, 4-fluor-benzyl bromide to the imidazolidinic ring. The 3-(4-fluor-benzyl)-imidazolidin-2,4-dione suffered a thionation in the carbonyl at 4-position. Afterwards, the substitution in position 5 of the thiazolidinic and imidazolidinic derivatives was carried out by a Michel addition of the 3-(4-methyl-benzyl)-thiazolidin-2,4-dione and 3-(4-fluor-benzyl)-4-thioxo-imidazolidin-2-one with substituted derivatives of ethyl 3-aryl-2-cyano-acrylates. The chemical structures of the synthesized compounds were absolutely confirmed by infra red spectroscopy (IR), nuclear magnetic resonance (^1H NMR) and mass spectroscopy (MS). The anti-inflammatory assays were carried out by the carrageenin-induced paw edema in Wistar rat to the 5-arylidene-3-(4-methyl-benzyl)-thiazolidin-2,4-dione derivatives using indomethacin as pattern.